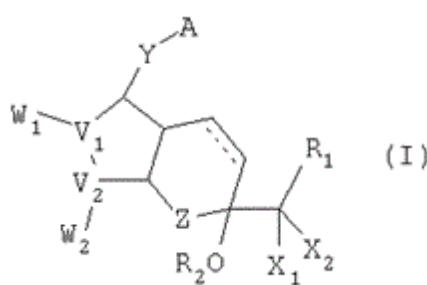


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам
рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации» (далее – Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2278666, поступившее 23.05.2018 от Акционерного общества «Нижегородский химико-фармацевтический завод» (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

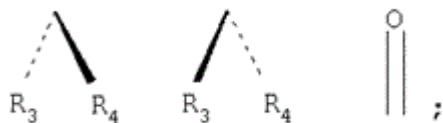
Патент Российской Федерации №2278666 на группу изобретений «Композиция слабительного средства» выдан по заявке №2003109622/15 с приоритетом от 04.09.2001 на имя СУКАМПО АГ (Швейцария) (далее - патентообладатель) и действует со следующей формулой:

«1. Композиция слабительного средства, которая включает в себя эффективное, в качестве слабительного, количество бициклического соединения, представленного формулой (I)



где V_1 и V_2 представляют собой атомы углерода;

W_1 и W_2 представляют собой



R_3 и R_4 представляют собой атом водорода или один из этих заместителей является группой OH ;

X_1 и X_2 представляют собой атом водорода, низший алкил или атом галогена, причем, по меньшей мере, один из них является атомом галогена;

Z представляет собой атом кислорода;

R_2 представляют собой атом водорода или алкил;

Y представляет собой насыщенную или ненасыщенную C_{2-10} углеводородную цепь;

A представляет собой $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{COCH}_2\text{OH}$, $-\text{COOH}$, или их функциональное производное;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший углеводородный остаток, имеющий неразветвленную или разветвленную цепь;

связь между положениями С-13 и С-14 является двойной или простой связью;

$C-15$ имеет пространственную конфигурацию R , S или их смесь.

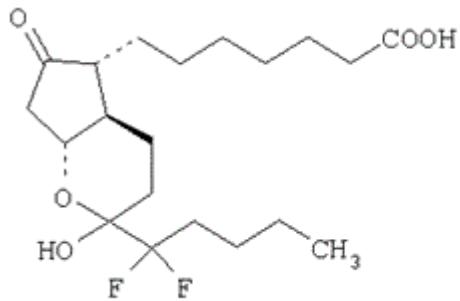
2. Композиция по п.1, которая дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером формулы (I), в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 1:1.

3. Композиция по п.1, которая дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером формулы (I), в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 20:1.

4. Композиция по п.1, в которой A является группой $-\text{COOH}$, W_1 является кето-группой, R_2 является атомом водорода и X_1 и X_2 представляют собой атомы фтора.

5. Композиция по п.1, в которой А является группой $-COOH$, Y представляет собой $(CH_2)_6$, W₁ является O, R₃ и R₄ представляют собой атомы водорода, X₁ и X₂ представляют собой атомы фтора и R₁ представляет собой $-(CH_2)_3CH_3$.

6. Композиция по п.1, в которой бициклическое соединение представляет собой



7. Композиция по любому одному из пп.1-6, которая дополнительно включает в себя триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

8. Композиция по п.7, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

9. Композиция по п.8, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

10. Композиция по п.9, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

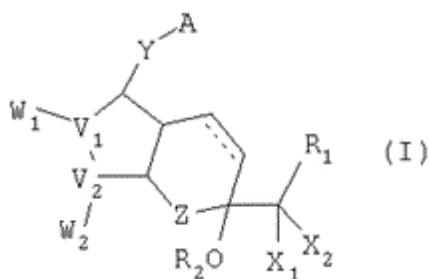
11. Композиция по п.7, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

12. Композиция по п.11, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

13. Композиция по любому одному из пп.1-12 для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей, страдающих запором.

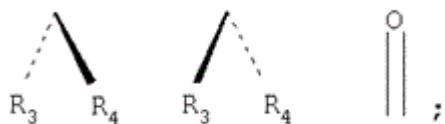
14. Композиция по любому одному из пп.1-12, которая применяется для очистки кишечника.

15. Способ, обеспечивающий слабительное действие для нуждающихся в этом пациентов, который включает в себя введение пациенту композиции, содержащей эффективное, в качестве слабительного, количество бициклического соединения формулы (I)



где V_1 и V_2 представляют собой атомы углерода;

W_1 и W_2 представляют собой



R_3 и R_4 представляют собой атом водорода или один из этих заместителей является группой OH ;

X_1 и X_2 представляют собой атом водорода, низший алкил или атом галогена, причем, по меньшей мере, один из них является атомом галогена;

Z представляет собой атом кислорода;

R_2 представляют собой атом водорода или алкил;

Y представляет собой насыщенную или ненасыщенную C_{2-10} углеводородную цепь;

A представляет собой $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{COCH}_2\text{OH}$, $-\text{COOH}$, или их функциональное производное;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший углеводородный остаток, имеющий неразветвленную или разветвленную цепь; низшую циклоалкилокси-группу; арильную группу; арилоксигруппу; гетероциклическую группу; гетероциклическую оксигруппу;

связь между положениями С-13 и С-14 является двойной или простой связью;

С-15 имеет пространственную конфигурацию R, S или их смесь.

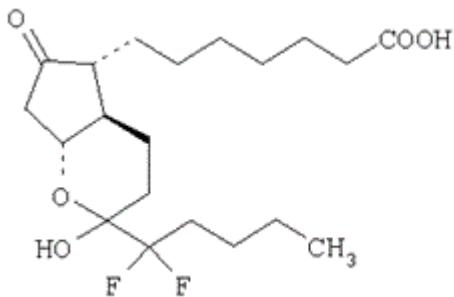
16. Способ по п.15, в котором композиция дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером формулы (I), в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 1:1.

17. Способ по п.16, в котором соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равно 20:1.

18. Способ по п.15, в котором А является группой -COOH, W₁ является кето-группой, R₂ является атомом водорода и X₁ и X₂ представляют собой атомы фтора.

19. Способ по п.15, в котором А является группой -COOH, Y представляет собой (CH₂)₆, W₁ является O, R₃ и R₄ представляют собой атомы водорода, X₁ и X₂ представляют собой атомы фтора и R₁ представляет собой -(CH₂)₃CH₃.

20. Способ по п.15, в которой бициклическое соединение представляет собой



21. Способ по любому из пп.15-20, в котором композиция дополнительно включает в себя триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

22. Способ по п.21, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

23. Способ по п.22, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

24. Способ по п.23, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

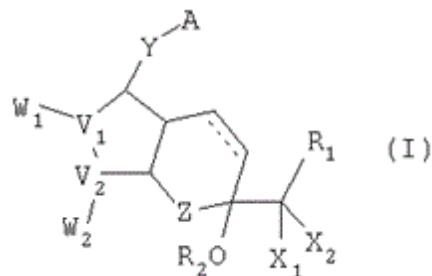
25. Способ по п.21, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

26. Способ по п.25, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

27. Способ по любому из пп.15-26, для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей.

28. Способ по любому из пп.15-26, который применяется для очистки кишечника.

29. Применение бициклического соединения формулы (I)



где V_1 и V_2 представляют собой атомы углерода;

W_1 и W_2 представляют собой



R_3 и R_4 представляют собой атом водорода или один из этих заместителей является группой OH ;

X_1 и X_2 представляют собой атом водорода, низший алкил или атом галогена, причем, по меньшей мере, один из них является атомом галогена;

Z представляет собой атом кислорода;

R₂ представляют собой атом водорода или алкил;

Y представляет собой насыщенную или ненасыщенную C₂₋₁₀ углеводородную цепь;

A представляет собой -CH₂OH, -COCH₂OH, -COOH, или их функциональное производное; и

R₁ представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший углеводородный остаток, имеющий неразветвленную или разветвленную цепь;

связь между положениями С-13 и С-14 является двойной или простой связью, и

C-15 имеет пространственную конфигурацию R, S или их смесь, для изготовления композиции слабительного средства.

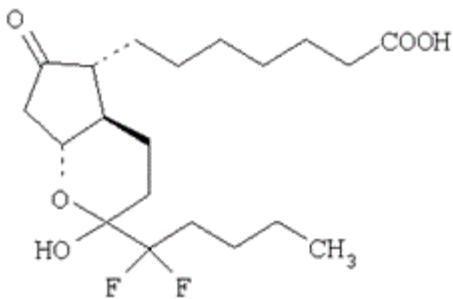
30. Применение по п.29, в котором композиция дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером формулы (I), в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере равное 1:1.

31. Применение по п.30, в котором соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере равно 20:1.

32. Применение по п.29, в котором A является группой -COOH, W₁ является кето-группой, R₂ является атомом водорода и X₁ и X₂ представляют собой атомы фтора.

33. Применение по п.29, в котором A является группой -COOH, Y представляет собой группу (CH₂)₆, W₁ является группой =O, R₃ и R₄ представляют собой атомы водорода, X₁ и X₂ представляют собой атомы фтора и R₁ представляет собой -(CH₂)₃CH₃.

34. Применение по п.29, в котором бициклическое соединение представляет собой



35. Применение по любому одному из пп.29-34, в котором композиция дополнительно включает в себя триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

36. Применение по п.35, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

37. Применение по п.36, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

38. Применение по п.37, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

39. Применение по п.35, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

40. Применение по п.39, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

41. Применение по любому из пп.29-40 для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей.

42. Применение по любому из пп.29-40 для очистки кишечника.

В соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса против выдачи данного патента было подано возражение, мотивированное несоответствием

изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» «новизна» и «изобретательский уровень».

К возражению приложены копии следующих источников информации:

- патент US 5317032, дата публикации 31.05.1994 (далее - [1]);
- патент EP 0430551, дата публикации 05.06.1991 (далее - [2]);
- патент US 5166174, дата публикации 24.11.1992 (далее - [3]);
- патент EP 0455448, дата публикации 06.11.1991 (далее - [4]);
- патент US5650172, дата публикации 22.07.1992 (далее - [5]);
- справочное пособие Р.О'Брайен, Жиры и масла. Производство, состав и свойства, применение. Спб.: Профессия, 2007, на 10 л. (далее - [6]).

Как указано, в возражении, справочное пособие [6], не относящееся к уровню техники использовано в качестве справочной литературы.

По мнению лица, подавшего возражение, группа изобретений по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» поскольку в описании к оспариваемому патенту не представлены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения и на основании описания к оспариваемому патенту невозможно убедиться в том, что в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного назначения.

Так, в возражении отмечено, что отсутствуют сведения, подтверждающие возможность получения всех бициклических соединений формулы (I) с разными по химической природе радикалами. В частности, в формуле оспариваемого патента радикал Z в шестичленном кольце представляет собой гетероатом кислород, при этом в описании к оспариваемому патенту методики синтеза таких соединений не приведены. Сведения на с. 9-17 описания относятся к получению соединений с шестичленным кольцом без гетероатома

или с серой, или азотом в качестве гетероатома, а конкретные примеры получения заявленных бициклических соединений не приведены.

Кроме того, отсутствуют сведения, подтверждающие возможность получения только бициклической формы заявленных соединений. В примерах композиции 1 и 2 с триглицеридами жирных кислот не указано, в какой таутомерной форме находились соединения в композиции.

Также лицом, подавшим возражение, отмечено, что в примерах на активность кишечных скоплений (далее - энтеропулинг) на с. 21-22 описания к оспариваемому патенту, описывается эффект соединений формулы (I) различной структуры, однако не указано, в какой среде соединения были введены, что не позволяет понять какое соотношение структур (моноциклическая/бициклическая) было на момент введения реципиенту. Соотношения структур (третья строка табл. 6 и 7) измерены не в композиции со средой, которую непосредственно вводили, а до введения в растворителе CDCl₃.

Относительно несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» в возражении отмечено следующее.

Независимый пункт 1 формулы по оспариваемому патенту известен из уровня техники, в частности, описан в патенте [1].

Из патента [1] известно использование в качестве слабительного 15-кето-простагландинов типа Е (далее – простогландины). В частности, в патенте [1] описаны моноциклические таутомерные формы 15-кето простагландинов типа Е. Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, в описании к патенту [1] раскрыто, что 15-кето-простагландины типа Е включают изомеры указанных соединений, в частности кето-гемиацетальные таутомеры между гидроксильной группой положения С11 и карбонильной группой положения С15, а именно бициклические формы 15-кето-простагландинов типа Е.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, 15-кето-простагландины типа Е в бициклической таутомерной форме, в части значений

радикалов, подпадают под общую структуру бициклического соединения формулы (I) по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту.

Также в патенте [1] раскрыты и охарактеризованы конкретные соединения:

метиловый сложный эфир 13,14-дигидро-15-кето-16R,S-фтор-20-метил-PGE2;
13,14-дигидро-15-кето-16R,S фтор-20-метил-PGE2;
13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор-20-метил-PGE2;
13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор-20-этил- PGE2;
этиловый сложный эфир 13,14-дигидро-15-кето-16R,S-фтор-PGE2;
метиловый сложный эфир 13,14-дигидро-15-кето-16R,S-фтор-20-метил- PGE2;
15-кето-16R,S-фтор-PGE2;
метиловый сложный эфир 15-кето-16R,S-фтор-PGE2;
метиловый сложный эфир 13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор- PGE2,
которые в бициклической таутомерной форме подпадают под общую структуру бициклического соединения формулы (I).

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что из патента [1] также известно, что 15-кето-простагландины типа Е можно использовать в композициях, которые применимы в качестве слабительного средства. Композиции могут быть твердые для перорального введения, жидкие, инъецируемые композиции и т.д. В экспериментальных примерах 5 и 6 описания к патенту [1] для подтверждения слабительного эффекта пациентам перорально вводили 16,16-дифтор-13,14-дигидро-15-кето-PGE2 в смеси с кокосовым маслом.

Относительно несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено следующее.

В патенте [1] не приведен синтез и тестирование конкретных 13,14-дигидро-15-кето-простагландинов типа PGE1, в которых связь между положениями C5-C6 является простой, что соответствует бициклическому соединению формулы (I) по оспариваемому патенту. Однако полный синтез

таких соединений известен из патента [2], в котором, в частности, раскрыт синтез соединения 13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор-PGE1, которое также существует в виде моноциклической и бициклической таутомерных формах (соединение 39', пример 2, с.18-19 описания патента [2]).

По мнению лица, подавшего возражение, согласно описанию (с.5, 8-10), в оспариваемом патенте решается задача обеспечения композиции, содержащей бициклическое соединение, проявляющей слабительное действие без побочных эффектов на кишечник. Соответственно, как отмечено в возражении, технический результат группы изобретений по оспариваемому патенту состоит в слабительном эффекте, который измеряли с помощью теста на энтеропулинг.

Полученный результат продемонстрирован для соединений примера 1 (соединения А и В) и для соединений примера 2 (соединения С и D) оспариваемого патента.

В патente [1] получены и протестираны в качестве слабительного с помощью теста на энтеропулинг соединения 8 и 2.

По мнению лица, подавшего возражение, соединение 8 из патента [1] соответствует соединению С по оспариваемому патенту, а соединение 2 из патента [1] соответствует соединению D.

На основании результатов исследований ^1H -ЯМР, снятых в растворителе CDCh в патенте [1] для соединений 8 и 2 и аналогичного исследования ^1H -ЯМР в оспариваемом патенте, лицом, подавшим возражение, сделан вывод о том, что соединения 8 и 2 согласно патенту [1] имеют такое же соотношение моноциклической/бициклической структуры как и соединения С и D по оспариваемому патенту. Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что соединения известные из патента [1] проявляют активность, идентичную в качественном и количественном отношении с соединениями по оспариваемому патенту.

По мнению лица, подавшего возражение, признаки зависимых пунктов 2, 3, 16, 17, 30 и 31 известны из совокупности сведений из патентов [1], [2], [3] и [4]. Признаки зависимых пунктов 3, 4, 5, 6, 18, 19, 20, 32, 33 и 34 известны из

патента [2]. Признаки зависимых пунктов 7, 11, 12, 21, 25, 26, 35, 39 и 40 известны из патента [1] с учетом сведений из справочного пособия [6], а также из совокупности сведений из патентов [2], [4] и [5]. Признаки зависимых пунктов 8, 9, 10, 22, 23, 24, 36, 37 и 38 известны из совокупности сведений из патентов [2] и [4]. Признаки зависимых пунктов 13-14, 27, 28, 41 и 42 известны из патента [1].

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя.

Отзыв от патентообладателя поступил 17.08.2018.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- декларация по форме 1.132 от 14.07.2010 (далее - [7]);
- статья Wojnarowska et al, «On the kinetics of tautomerism in drugs: New application of broadband dielectric spectroscopy», J.Chem.Phys. 07.09.2010 (далее – [8]).

В своем отзыве патентообладатель отмечает, что назначение группы изобретений указано в каждом из независимых пунктов формулы по оспариваемому патенту.

В описании к оспариваемому патенту приведены различные схемы синтеза соединений по изобретению (с.7-14 описания к оспариваемому патенту) и указано, как получить бициклические соединения формулы (I) и стабилизировать их с применением определенных растворителей (с.7 и 14 описания). В описании группы изобретений по оспариваемому патенту также представлена подробная информация о форме композиции, об ингредиентах, которые могут быть в нее дополнительно включены, об эффективном количестве активного ингредиента (с. 20-21 описания). Приведены сведения о выявленных факторах, влияющих на этиопатогенез заболевания и механизме воздействия на них бициклических простагландинов (с.6 описания).

Эффективность бициклических простагландинов продемонстрирована в примерах 1 и 2 в teste на энтеропулинг и в teste на диарею путем приведения количественных результатов указанных испытаний. Причем, в примере 1 и 2

показана эффективность композиции, содержащей преимущественно 96:4 соотношения бициклической к моноциклической формам соединения любипростон, которая в превышает эффективность композиции, содержащей другой бициклический простагландин в соотношении 1:1, и в сотни раз превышает эффективность композиции, содержащей простагландин в моноциклической форме. При этом, патентообладатель в своем отзыве отмечает, что наличие бициклической формы соединения показано для смеси его с СDCI3, а не для смеси, которая вводилась подопытным, на примере которой показана очень высокая активность бициклических соединений в teste на энтеропулинг. Для получения композиции по изобретению используют триглицериды жирной кислоты со средней цепочкой, поскольку они стабилизируют бициклические простагландины.

В поддержку того, что именно бициклическое соединение формулы (I) является активным компонентом композиции по изобретению, и что именно соединение любипростон исследовалось в примере 1, патентообладатель приводит декларацию [7], представленную в патентное ведомство США.

Относительно несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» патентообладатель отмечает, что патент [1] не описывает бициклических соединений формулы (I), которые лежат в основе оспариваемой группы изобретений. В патенте [1] в колонках 3-5 описано множество вариантов 15-кето-16 простагландинов А, простагландинов Е и простагландинов F. В описании патента [1] в колонке 5 на строках 35-45 декларируется наличие изомеров, в том числе таутомеров таких соединений, что, по мнению патентообладателя, является не более чем общим теоретическим предположением.

Патентообладатель также отмечает, что в патенте [1] описывается пероральное введение соединения 13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор-PGE2 в смеси с кокосовым маслом, содержащим глицериды, однако указанное соединение не является соединением, для которого в патенте [1] декларируется таутомерное равновесие.

Кроме того, в возражении со ссылкой на статью [8], отмечено, что таутомеры соединений могут характеризоваться разной активностью.

Относительно довода о несоответствии группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» патентообладатель отмечает, что патент [2] относится к средствам иного назначения, а именно для лечения сердечной недостаточности. При этом, патентообладатель в своем отзыве подчеркивает, что ни один из противопоставленных патентов [1] и [2] не описывает бициклические формы соединений формулы (I), которые лежат в основе группы изобретений по оспариваемому патенту.

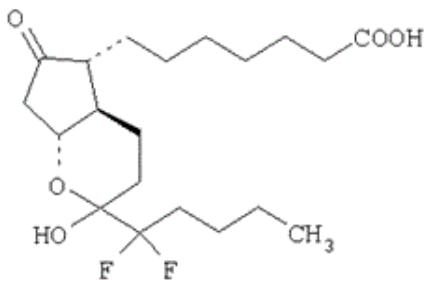
Технический результат, по мнению патентообладателя, изложен на с.20 описания к оспариваемому патенту и заключается в том, что «композиции настоящего изобретения вызывают очень сильный эффект в отношении скоплений внутри кишечника, ингибируя поглощение воды в кишечнике».

Как отмечено в отзыве, в патентах [1] и [2] не раскрыт ни технический результат, обеспечиваемый оспариваемым изобретением, ни влияние бициклической формы соединений формулы (I) оспариваемой группы изобретений на его достижение. В частности, возможность столь значительно увеличить активность простагландинов, как показано в примерах 1 и 2 описания оспариваемого патента, путем обеспечения определенного содержания бициклической формы в фармацевтической композиции, не раскрыта и не следует из противопоставленных патентов [1] и [2].

Таким образом, патентообладатель акцентирует внимание на том, что изобретения по независимым пунктам 1, 15 и 29 формулы по оспариваемому патенту не следуют очевидным образом из противопоставленных патентов [1] и [2], взятых как по отдельности, так и в комбинации, что указывает на то, что они соответствуют условию изобретательского уровня.

Тем не менее, патентообладатель считал необходимым вместе с отзывом, поступившим 17.08.2018, представить уточненную формулу группы изобретений. Формула уточнена путем ограничения всего объема притязаний в

части бициклического соединения формулы (I) конкретным соединением любипростон, имеющим следующую структуру



Кроме того, формула уточнена путем внесения в независимый пункт 1 признаков зависимых пунктов 2, 6 и 7, внесения в независимый пункт 15 признаков зависимых пунктов 16, 20 и 21, внесения в независимый пункт 29 признаков зависимых пунктов 30, 34 и 35 и путем исключения зависимых пунктов 4, 5, 18, 19, 32, 33 с соответствующим изменением нумерации.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (04.09.2001), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки изобретения по указанному патенту условиям патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации от 23 сентября 1992 г. №3517-І (далее - Закон) и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 20.09.1993, зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 05.11.1993 № 386 (далее - Правила).

В соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1 Правил ИЗ, при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступными до даты приоритета изобретения. Кроме того, следует убедиться в том, что, в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

В соответствии с подпунктом 4 пункта 19.5.1 Правил ИЗ, в отношении изобретения, для которого установлено несоответствие условию промышленной применимости, проверка новизны и изобретательского уровня не проводится.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.2. Правил проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.2. Правил изобретение не признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.3. Правил проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил;

- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);

- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.3. Правил изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 3.2.4.2. Правил в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения, характеризуемое совокупностью признаков, сходной с совокупностью существенных признаков изобретения.

При описании каждого из аналогов приводятся библиографические данные источника информации, в котором он раскрыт, признаки аналога с указанием тех из них, которые совпадают с существенными признаками заявляемого изобретения, а также указываются известные заявителю причины, препятствующие получению требуемого технического результата.

Согласно пункту 22.3 Правил при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено.

Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, для сведений о техническом средстве, ставших известными в результате его использования, является документально подтвержденная дата, с которой эти сведения стали общедоступными.

Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, для отчетом о научно-исследовательский работах, пояснительных записок к опытно-конструкторским работам и другой конструкторской, технологической и проектной документации, находящейся в органах научно-технической информации, является дата их поступления в эти органы.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение, полезную модель и промышленный образец, коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, в случае, если без внесения указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении могут быть признаны недействительным частично. Указанные изменения должны соответствовать изменениям формулы изобретения, которые предусмотрены правилами составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, правилами составления, действовавшими на дату подачи заявки.

Согласно пункту 5.1. Правил ППС в случае, если патентообладателем по предложению Палаты по патентным спорам внесены изменения в формулу изобретения, решение Палаты по патентным спорам должно быть принято с учетом результатов дополнительного информационного поиска, проведенного в полном объеме.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень» показал следующее.

Следует согласиться с мнением патентообладателя о том, что в каждом независимом пункте 1, 15 и 29 формулы по оспариваемому патенту указано назначение изобретений.

Общие схемы синтеза соединений формулы (I) на которых основываются изобретения по независимым пунктам 1, 15 и 20 изложены на с.13-17 описания оспариваемого патента.

Получение композиции и ее виды, раскрыты на с.18-21 описания по оспариваемому патенту.

Однако, реализация назначения, а именно «обеспечение слабительного действия» показана только для конкретных соединений, в которых в общей формуле (I) радикал Z представляет собой гетероатом кислород, кето группа присутствует в положении С-9, число атомов фтора в положении С-16 от 1 до 2. В которых связь между положениями С5-С6 является простой (пример 1, соединения А и В) и аналогичных соединений, в которых имеется двойная связь между атомами С5-С6 (пример 2, соединения С и D).

Кроме того, влияние соединений по оспариваемому патенту на перистальтику кишечника показано только для композиции, в которой соединения растворены и стабилизированы в триглицериде жирной кислоты со средней цепочкой.

В описании к оспариваемому патенту недостаточно сведений о возможности реализации назначения для всего объема соединений формулы (I), входящих в композицию.

Таким образом, следует констатировать, что группа изобретений по независимым пунктам 1, 15 и 29, которые основаны на бициклических соединениях формулы (I) не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость».

Представленная патентообладателем уточненная формула, ограничена в отношении соединений формулы (I) входящих в объекты по независимым пунктам 1, 15 и 29 соединением соответствующим примеру 1 (соединение А - любипростон).

Соединение А представляет собой 13,14-дигидро-15-кето-простагландин типа PGE1, в котором связь между положениями С5-С6 является простой и в структуре имеются два атома фтора. Соединение А испытано на биологическую активность в примере 1. Испытания композиции соединения А, растворенного в

триглицериде жирной кислоты со средней цепочкой на перистальтику кишечника представлены на с.22-23 описания оспариваемого патента.

Поскольку реализация назначения для соединения А в описании к оспариваемому патенту показана в достаточной степени, можно констатировать, что уточненная патентообладателем формула группы изобретений, соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость».

Относительно соответствия группы изобретений условию патентоспособности «новизна» следует отметить следующее.

Ни один из патентных документов [1]-[5] не описывает композицию, содержащую простогландин бициклической структуры, такой как любипростон, входящий в состав композиции по оспариваемому патенту.

Действительно, что справедливо отмечено в возражении, в патенте [1] не приведен синтез и тестирование конкретных 13,14-дигидро-15-кето-простагландинов типа PGE1, в которых связь между положениями C5-C6 является простой, что соответствует соединению примера 1(А) – любипростона, входящего в объем уточненной формулы, лежащего в основе изобретений по независимым пунктам 1, 15 и 29 по оспариваемому патенту. Таким образом, можно констатировать, что изобретения, представляющие собой композицию по пункту 1, способ, обеспечивающий слабительное действие по пункту 15 и применение по пункту 29 формулы по оспариваемому патенту, основанные на соединении любипростон, соответствуют условию патентоспособности «новизна».

Относительно соответствия группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» следует отметить следующее.

Техническое решение по патенту [1] является наиболее близким аналогом группы изобретений по оспариваемому патенту. Патент [1] описывает моноциклические простагландины, которые полезны в качестве слабительных средств. При этом в патенте [1] есть предпосылка общего принципа получения

бициклических простагландинов путем каталитического восстановления двойной связи C5-C6 (столбец 7 строка 14). Однако соединение 13,14-дигидро-15-кето-16,16-дифтор-PGE2 не является соединением, для которого в патенте [1] декларируется таутомерное равновесие, т.е. наличие как моноциклической так и бициклической структур.

В патенте [2] приведен полный синтез соединения 16,16-дифтор-13,14-дигидро-15-кето-20-метил-PGE1 (связь между положениями C5-C6 является простой), которое не было идентифицировано на принадлежность к какой-либо таутомерной форме (пример 39'). В описании к патенту [2] все соединения представлены структурной формулой или номенклатурой кето-типа (моноциклическая форма), однако декларативно отмечено, что не исключаются соединения полуацетального типа (бициклическая форма). Конкретные соединения в бициклической таутомерной форме в патенте [2] не получали и в композиции не использовали. Композиции соответствующие уточненной формуле патентообладателя в патенте [2] не раскрыты. Кроме того, патент [2] направлен на решение иной технической задачи, а именно на лечение дисфункции легких.

Таким образом, можно констатировать, что изобретения, представляющие собой композицию по пункту 1, способ, обеспечивающий слабительное действие по пункту 15 и применение по пункту 29 формулы по оспариваемому патенту, основанные на соединении любипростон соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Ввиду того, что патентообладатель уточнил формулу изобретения не только ограничив бициклические соединения формулы (I) до конкретного полученного и испытанного соединения любипростон, но и внес признаки зависимых пунктов, уточняющие соотношение таутомерных форм в соединении и вид стабилизирующего растворителя, уточненная формула, в соответствии с п.5.1. Правил ППС была направлена на дополнительный информационный поиск.

По результатам проведения указанного поиска 10.12.2018 был представлен отчет и заключение экспертизы, согласно которым группа изобретений по уточненной заявителем и представленной в отзыве от 17.08.2018 формуле удовлетворяет всем условиям патентоспособности, предусмотренным п.1 статьи 4 Закона.

Таким образом, каких-либо обстоятельств, препятствующих признанию заявленного изобретения патентоспособным в объеме упомянутой выше уточненной формулы, не выявлено.

Лицом, подавшим возражение, на заседании коллегии, состоявшимся 14.02.2019 представлен отзыв на заключение экспертизы, в котором доводы о несоответствии уточненной формулы группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень» по существу повторяют доводы, изложенные в возражении.

Так, в представленных доводах, лицо, подавшее возражение акцентирует внимание на явления таутомерии, а именно на самопроизвольном переходе таутомеров друг в друга с образованием динамического равновесия между ними (Химическая Энциклопедия, под ред. Н.С. Зефирова, М.: Большая Российская Энциклопедия, 1995, Том 4, стр. 499-500) в соответствии с которым, бициклическая форма всегда присутствует с тем или иным отношением к моноциклической форме в зависимости от условий среды.

Здесь целесообразно отметить, что как было раскрыто выше, ни в одном из противопоставленных в возражении патентных документах [1] и [2] не раскрыты сведения, позволяющие получить и стабилизировать какие либо бициклические простагландины. Соответственно, отсутствуют сведения и об их биологической активности. При этом целесообразно подчеркнуть, что дополнительный информационный поиск также не выявил в уровне техники сведений о стабилизованных бициклических 15-кето простогландинов с заданной биологической активностью.

Материалы [7], представляют собой мнение частного лица, не входят в уровень техники и не могут быть использованы при анализе патентоспособности оспариваемой группы изобретений в данном заключении.

Учитывая вышеизложенное, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

удовлетворить возражение, поступившее 23.05.2018 патент РФ на изобретение №2278666 признать недействительным частично и выдать новый патент на изобретение с уточненной формулой, представленной в корреспонденции от 17.08.2018.

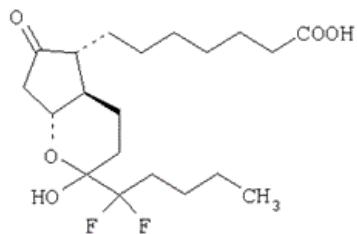
(21) 2003109622/04

(51) МПК

A61K 31/5575 (2006.01)

A61P 1/10 (2006.01)

(57) 1. Композиция слабительного средства, которая включает в себя эффективное, в качестве слабительного, количество бициклического соединения, представленного формулой



которая дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером указанного бициклического соединения в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 1:1, а также триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

2. Композиция по п.1, которая дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером формулы (I), в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 20:1.

3. Композиция по п.1, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

4. Композиция по п.3, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения формулы (I).

5. Композиция по п.4, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

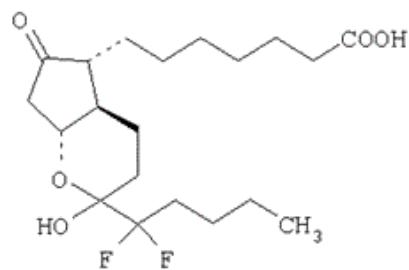
6. Композиция по п.1, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

7. Композиция по п.6, в которой триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

8. Композиция по любому одному из пп.1-7 для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей, страдающих запором.

9. Композиция по любому одному из пп.1-7, которая применяется для очистки кишечника.

10. Способ, обеспечивающий слабительное действие для нуждающихся в этом пациентов, который включает в себя введение пациенту композиции, содержащей эффективное, в качестве слабительного, количество бициклического соединения формулы



в котором композиция дополнительно включает в себя соединение, являющеесяmonoциклическим таутомером указанного бициклического соединения, в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической

структуры к моноциклической, по меньшей мере, равное 1:1, а также триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

11. Способ по п.10, в котором соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере, равно 20:1.

12. Способ по п.10, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес.ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

13. Способ по п.12, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

14. Способ по п.13, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

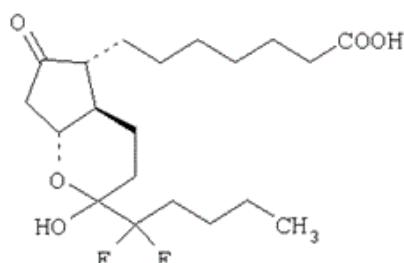
15. Способ по п.10, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

16. Способ по п.15, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

17. Способ по любому из пп.10-16, для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей.

18. Способ по любому из пп.10-16, который применяется для очистки кишечника.

19. Применение бициклического соединения



для изготовления композиции слабительного средства, которое дополнительно включает в себя соединение, являющееся моноциклическим таутомером указанного бициклического соединения, в количестве, обеспечивающем соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере равное 1:1, а также триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой.

20. Применение по п.19, в котором соотношение бициклической структуры к моноциклической, по меньшей мере равно 20:1.

21. Применение по п.19, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 1 до 1000000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

22. Применение по п.21, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 5 до 500000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

23. Применение по п.22, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой присутствует в количестве от 10 до 200000 вес. ч. в расчете на одну весовую часть бициклического соединения.

24. Применение по п.19, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид жирной кислоты, содержащей 6-14 атомов углерода.

25. Применение по п.24, в котором триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой представляет собой триглицерид каприловой кислоты и/или каприновой кислоты.

26. Применение по любому из пп.19-25 для облегчения и профилактики запора у пациентов-людей.

27. Применение по любому из пп.19-25 для очистки кишечника.

(56) US 5317032, 31.05.1994

EP 0430551, 05.06.1991

US 5166174, 24.11.1992

EP 0455448, 06.11.1991

US 5650172, 22.07.1992

EP 0310305, 05.04.1989

SU 1082321, 23.03.1984

Примечание: при публикации сведений о выдаче патента будут использовано первоначальное описание в редакции заявителя.